516,743



## PATENT COOPERATION TREATY

# **PCT**

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

anslation internat	PATENT COOPERA	TION TREA	ATY	PCT/JP2003/00	
slatic	PC7	Γ			
INTERNAT	TIONAL PRELIMINAR	Y EXAMINA	ATION REP	PORT	
	(PCT Article 36 a	nd Rule 70)			
Applicant's or agent's file reference RFH1505-1559	FOR FURTHER ACTIO	See Notific Preliminary	cation of Tra Examination Re	ansmittal of Internation eport (Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2003/007189	International filing date (da) 06 June 2003 (06.6		1	ate (day/month/year) June 2002 (07.06.2002)	
International Patent Classification (IPC) or C07D 491/044, A61K 31/407,	r national classification and IPC		1		
Applicant	RIKEN		`		
This international preliminary example and is transmitted to the applicant.	amination report has been prepa t according to Article 36.	red by this Intern	national Prelimi	inary Examining Authority	
2. This REPORT consists of a total	of 3 sheets, inch	ding this cover	sheet.		
amended and are the basis	nanied by ANNEXES, i.e., sheets for this report and/or sheets conthe Administrative Instructions	ntaining rectific	ion, claims and/ ations made be	or drawings which have be fore this Authority (see Ru	
These annexes consist of a	a total ofsheet	s.			
3. This report contains indications r	relating to the following items:				
I Basis of the repo	ort				
II Priority					
III Non-establishme	ent of opinion with regard to nov	elty, inventive s	tep and industri	ial applicability	
IV Lack of unity of	invention				
V Reasoned statem citations and exp	nent under Article 35(2) with repolanations supporting such state	ard to novelty, i nent	nventive step of	r industrial applicability;	
VI Certain documen	nts cited				
VII Certain defects i	n the international application				
VIII Certain observat	tions on the international applica	ition			
Date of submission of the demand	Da	te of completion	of this report		
25 November 2003 (2	25.11.2003)	01	l April 2004	(01.04.2004)	
Name and mailing address of the IPEA/	JP Au	thorized officer			
Facsimile No.	Te	lephone No.			



### INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

## PCT/JP2003/007189

I. Basis of the report							
1. With regard to the elements of the international application:*							
the international application as originally filed							
the description:							
pages, as originally filed							
pages, filed with the demand							
pages, filed with the letter of							
the claims:							
nages							
pages, as originary fried, as originary fried, as amended (together with any statement under Article 19							
pages, filed with the demand							
pages, filed with the letter of							
the drawings:							
mages							
pages, filed with the demand pages, filed with the letter of							
the sequence listing part of the description:							
pages, as originally filed							
pages, filed with the demand							
pages, filed with the letter of							
2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item. These elements were available or furnished to this Authority in the following language which is:							
the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).							
the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).							
the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).							
3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:							
contained in the international application in written form.							
filed together with the international application in computer readable form.							
furnished subsequently to this Authority in written form.							
furnished subsequently to this Authority in computer readable form.							
The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.							
The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.							
4. The amendments have resulted in the cancellation of:							
the description, pages							
the claims, Nos.							
the drawings, sheets/fig							
This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**							
* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).							
** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.							

#### INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No. PCT/JP 03/07189

v.	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement				
1.	Statement				
	Novelty (N)	Claims	2-7	YES	
		Claims	1, 8, 9	NO	
	Inventive step (IS)	Claims	5-7	YES	
	•	Claims	1-4, 8, 9	NO	
	Industrial applicability (IA)	Claims	1-9	YES	
		Claims		NO	

#### 2. Citations and explanations

Document 1: JP 8-269061 A

Document 2: Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi (2000), 58 (3),

pp. 183-191

The inventions set forth in claims 1, 8 and 9 are not novel over documents 1 and 2, cited in the international search report. Document 1 discloses the antitumour substance epolactaene, and document 2 also discloses its optically active isomers, and these fall within the scope of the compounds in these inventions in the present invention. Similarly, the inventions set forth in claims 1-4, 8 and 9 do not involve an inventive step in the light of documents 1 and 2. The compounds in these inventions in the present application are such as could be obtained easily by a person skilled in the art by mere transesterification of the ester group of a compound such as epolactaene above.

The inventions set forth in claims 5-7 are not disclosed or suggested in documents 1 and 2 cited in the international search report, and are novel and involve an inventive step.

#### 特許協力条約

PCT

### 国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条) [PCT36条及びPCT規則70]

REC'D	22	APR 2004
<b>WIPO</b>		PCT

出願人又は代理人 の書類記号 RFH1505-1559	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。						
国際出願番号 PCT/JP03/07189	国際出願日 (日.月.年) 06.06.2003 優先日 (日.月.年) 07.06.2002						
国際特許分類 (IPC) Int. Cl'	C07D491/044, A61K31/407, A61P35/00						
出願人 (氏名又は名称) 理化学研究所	•						
1. 国際予備審査機関が作成したこの国	国際予備審査報告を法施行規則第57条(PCT36条)の規定に従い送付する。						
2. この国際予備審査報告は、この表紀	€を含めて全部で3 ページからなる。						
(PCT規則70.16及びPCT この附属書類は、全部で	この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部でページである。						
3. この国際予備審査報告は、次の内容	を含む。 ·						
I × 国際予備審査報告の基礎							
Ⅱ    優先権							
Ⅲ	上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成						
IV 発明の単一性の欠如							
V X PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI  ある種の引用文献							
VII 国際出願の不備							
VII 国際出願に対する意見							
国際予備審査の請求沓を受理した日 国際予備審査報告を作成した日							
25.11.2003	国際予備審査報告を作成した日 01.04.2004						
名称及びあて先	特許庁審査官 (権限のある職員) 4 B 8 6 1 5						
日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915	· 内藤 伸一						
東古報子公田区歌北朗二十日(平)	TAME IT						

電話番号 03-3581-1101 内線

3448

#### 国際予備審查報告

国際出願番号 PCT/JP03/07189

Ι.	 	] 原予備審査報	告の基礎			
1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。 (法第6条 (PCT14条) の規定に基づく命令に 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。 PCT規則70.16,70.17)						
[	X	出願時の国際	<b>联書類</b>			
{		明細書 明細書 明細書	第 第	ページ、 ページ、 ページ、	出願時に提出されたもの 国際予備審査の請求部と	
1		請求の範囲 請求の範囲 請求の範囲	第	項、 項、 項、	出願時に提出されたもの PCT19条の規定に基 国際予備審査の請求書と	Sづき補正されたもの 出共に提出されたもの
		請求の範囲				付の書簡と共に提出されたもの
		図面 図面	第  第	ページ/図、 ページ/図、 ページ/図、	出願時に提出されたもの 国際予備審査の請求書と	) - 共に提出されたもの 付の書簡と共に提出されたもの
		明細書の配列	刊表の部分 第 刊表の部分 第 刊表の部分 第	ページ、 ページ、 ページ、	出願時に提出されたもの 国際予備審査の請求書と	
2.		上記の出願書類	質の言語は、下記に示す場	合を除くほか、こ	の国際出願の言語である。	
		上記の書類は、	下記の言語である	語であ	る。	
国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語  PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語  国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語  3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。						
3.					40,700,000	
			と出願に含まれる書面による と出願と共に提出された磁管		京刚表	
			。 に、この国際予備審査(ま)			漫
		出願後に	2、この国際予備審査(ま)	たは調査)機関に拡	是出された磁気ディスクに	よる配列表
				表が出願時における	る国際出願の開示の範囲を	:超える事項を含まない旨の陳述
書の提出があった 書の提出があった 書面による配列表に記録した配列が同一である旨の陳述書の提出 があった。						
4.		補正により、 ] 明細書	下記の書類が削除された。 第	<b>ページ</b>		
		請求の範囲			-ジノ図	
	L_	」図面	図面の第			
5. この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1. における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)						
ı						

#### 国際予備審査報告

国際出題番号 PCT/JP03/07189

v.	新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につい 文献及び説明	ての法第12条	(PCT35条(2))	に定める見解、	それを裏付ける
1.	見解				
	新規性 (N)	請求の範囲 _ 請求の範囲 _	2-7 1, 8, 9		
	進歩性(IS)	請求の範囲 請求の範囲	5-7 1-4; 8, 9	9	
į	<b>産業上の利用可能性 (IA)</b>	請求の範囲 _ 請求の範囲 _	1-9		有

#### 2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

文献1)JP 8-269061 A 2)Yuki Gosei Kagaku Kyokaishi (2000), 58(3), 183-191

請求の範囲1,8,9の発明は、国際調査報告で引用された文献1,2により新規性を有さない。文献1には、抗腫瘍性物質エポラクタンが記載され、文献2にはその光学活性体も記載されており、これらのものは、本願発明化合物に該当するものである。また、請求の範囲1-4,8,9の発明は、文献1,2により進歩性を有さない。本願発明化合物は、上記エポラクタン等のエステル基をエステル交換することにより当業者が容易に製造し得たものというほかはない。

請求の範囲5-7の発明は、国際調査報告で引用された文献1,2には記載も示唆もされておらず、新規性及び進歩性を有する。